

**Antibacterial, antimycotic and antiviral compositions based on alpha-hydroxyalkanoic acids and squalene**

(22)

**Publication number:** DE19543695**Publication date:** 1997-05-28**Inventor:** WOLF FLORIAN DR (DE); JUESTEL CAROLA (DE); SCHREIBER JOERG DR (DE); KLIER MANFRED DR (DE)**Applicant:** BEIERSDORF AG (DE)**Classification:**

**- international:** A61K8/30; A61K8/00; A61K8/14; A61K8/31; A61K8/36; A61K8/365; A61K8/368; A61K31/01; A61K31/19; A61K31/20; A61K31/22; A61K31/23; A61P17/00; A61P31/04; A61P31/12; A61Q1/00; A61Q1/04; A61Q1/06; A61Q5/00; A61Q5/02; A61Q5/12; A61Q15/00; A61Q19/00; A61K8/30; A61K8/00; A61K8/14; A61K31/01; A61K31/185; A61K31/21; A61P17/00; A61P31/00; A61Q1/00; A61Q1/02; A61Q5/00; A61Q5/02; A61Q5/12; A61Q15/00; A61Q19/00; (IPC1-7): A61K31/19

**- European:** A61K7/48C2; A61K7/48C4F3; A61K31/19; A61K31/20

**Application number:** DE19951043695 19951123**Priority number(s):** DE19951043695 19951123**Also published as:**

EP0775486 (A1)

JP9169629 (A)

**Report a data error here**

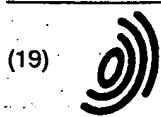
Abstract not available for DE19543695

Abstract of corresponding document: EP0775486

A combination (I) of: (a) one or more alpha -hydroxy acids of formula  $R'C(R'')(OH)COOH$  (I) or their salts and/or (m)ethyl esters; and (b) squalene is new:  $R'$ ,  $R''$  = H, 1-27C alkyl (optionally substituted by one or more COOH, OH, CHO and/or oxo) or phenyl (optionally substituted by one or more COOH, OH and/or 1-27C alkyl); or  $CR'R''$  = 3-7C cycloalkylidene optionally substituted by one or more COOH, OH, oxo and/or 1-27C alkyl.

---

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide



Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets



(11)

EP 0 775 486 A1

(12)

# EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(43) Veröffentlichungstag:  
28.05.1997 Patentblatt 1997/22

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>: A61K 31/01, A61K 45/06,  
C11B 11/00

(21) Anmeldenummer: 96117993.4

(22) Anmeldetag: 09.11.1996

(84) Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL

(30) Priorität: 23.11.1995 DE 19543695

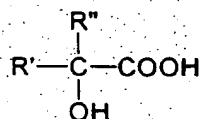
(71) Anmelder: Beiersdorf Aktiengesellschaft  
D-20245 Hamburg (DE)

(72) Erfinder:  
• Wolf, Florian, Dr.  
20251 Hamburg (DE)  
• Jüstel, Carola  
20144 Hamburg (DE)  
• Schreiber, Jörg, Dr.  
20146 Hamburg (DE)  
• Klier, Manfred, Dr.  
21521 Hamburg (DE)

(54) **Gegen Bakterien, Mycota und Viren wirksame Zusammensetzungen auf der Basis von alpha-Hydroxyalkansäuren und Squalen**

(57) Wirkstoffkombinationen aus

a) einer wirksamen Menge an einer oder mehreren  
α-Hydroxycarbonsäuren der allgemeinen Formel



und  
wobei die α-Hydroxycarbonsäure oder die α-Hydroxycarbonsäuren gegebenenfalls in Form ihrer physiologisch verträglichen Salze und/oder Ethylester und/oder Methylester vorliegen können

und

b) Squalen.

wobei jeweils R' und R'' unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe

(a1) H-,

(a2) verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-,

(a3) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Aldehydgruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) substituiertes verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-

(a4) Phenyl-,

(a5) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituiertes Phenyl-, oder wobei das α-Kohlenstoffatom der α-Hydroxycarbonsäure mit R' und R'' zusammen eine

(a6) unsubstituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen oder eine

(a7) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen ausbildet

EP 0 775 486 A1

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung an sich bekannter Substanzen als gegen Bakterien, Mycota und Viren wirksame Substanzen. In besonderen Ausführungsformen betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische und dermatologische Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend.

Der gesunde warmblütige Organismus, insbesondere die gesunde menschliche Haut, ist mit einer Vielzahl nicht-pathogener Mikroorganismen besiedelt. Diese sogenannte Mikroflora der Haut ist nicht nur unschädlich, sie stellt einen wichtigen Schutz zur Abwehr opportunistischer oder pathogener Keime dar.

Bakterien gehören zu den prokaryotischen Einzellern. Sie können grob nach ihrer Form (Kugel, Zylinder, gekrümmter Zylinder) sowie nach dem Aufbau ihrer Zellwand (grampositiv, gramnegativ) unterschieden werden. Feinere Unterteilungen tragen auch der Physiologie der Organismen Rechnung. So existieren aerobe, anaerobe sowie fakultativ anaerobe Bakterien. Manche Individuen sind in ihrer Eigenschaft als pathogene Keime von medizinischer Bedeutung, andere wiederum sind vollkommen harmlos.

Gegen Bakterien wirksame Substanzen sind seit geraumer Zeit bekannt. Der Begriff „Antibiotika“ beispielsweise, der nicht auf alle antimikrobiell wirksamen Substanzen anwendbar ist, läßt sich auf das Jahr 1941 datieren, obwohl die ersten Erkenntnisse zum Penicillin bereits im Jahre 1929 gefunden wurden. Antibiotika im heutigen Sinne sind nicht für alle medizinischen, schon gar nicht kosmetische Anwendungen geeignet, da häufig auch der warmblütige Organismus, also etwa der erkrankte Patient, bei Anwendung auf irgendeine Weise in seinen Stoffwechselfunktionen beeinträchtigt wird.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, den Stand der Technik in dieser Richtung zu bereichern, insbesondere also, Substanzen zur Verfügung zu stellen, welche gegen grampositive und/oder gramnegative Bakterien wirksam sind, ohne daß mit der Anwendung der Substanzen eine unvermeidbare Beeinträchtigung der Gesundheit des Anwenders verbunden wäre.

Gramnegative Keime sind beispielsweise *Escherichia coli*, *Pseudomonas*-Arten sowie *Enterobacteriaceae*, wie etwa *Citrobacter*.

Auch grampositive Keime spielen in Kosmetik und Dermatologie eine Rolle. Bei der unreinen Haut beispielsweise sind neben anderen Einflüssen bakterielle Sekundärinfektionen von ätiologischer Bedeutung. Einer der wichtigsten Mikroorganismen, der in Zusammenhang mit unreiner Haut steht, ist *Propionibacterium acnes*.

Unreine Haut und/oder Komedonen beeinträchtigen das Wohlbefinden der Betroffenen aber selbst in leichten Fällen. Da praktisch jeder oder jede Jugendliche von unreiner Haut irgendeiner Ausprägung betroffen ist, besteht bei vielen Personen Bedarf, diesem Zustand abzuweichen.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, einen gegen unreine Haut bzw. *Propionibacterium acnes* wirksamen Stoff bzw. Stoffkombination zu finden.

Die vorliegende Erfindung betrifft in einer weiteren Ausführungsform kosmetische Desodorantien. Solche Formulierungen dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich gemischte frische Schweiß durch insbesondere grampositive Mikroorganismen zersetzt wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosol-sprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien - vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) - die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber, abhängig von ihrer Dosierung, drastisch in den Wärmehaushalt der Achseiregion ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut beeinträchtigt werden kann. Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflusst, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich. Die Nachteile beider Wirkstoffklassen lassen sich auf diesem Wege jedoch nicht vollständig beseitigen.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, eine Methode, die am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Allerdings werden die meisten kosmetischen Desodorantien, wie auch die meisten Kosmetika insgesamt, parfümiert, selbst wenn sie desodorierende Wirkstoffe beinhalten. Parfümierung kann auch dazu dienen, die Verbraucherakzeptanz eines kosmetischen Produktes zu erhöhen oder einem Produkt ein bestimmtes Flair zu geben.

Die Parfümierung wirkstoffhaltiger kosmetischer Mittel, insbesondere kosmetischer Desodorantien, ist allerdings

nicht selten problematisch, weil Wirkstoffe und Parfümbestandteile gelegentlich miteinander reagieren und einander unwirksam machen können.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

- 5 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 10 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Zahl der Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen. Auf keinen Fall sollten die desodorierenden Wirkprinzipien sich auf der Haut anreichern.

Eine weitere Aufgabe war, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, welche mit einer möglichst großen Vielzahl an üblichen kosmetischen Hilfs- und Zusatzstoffen harmonisieren, insbesondere mit den gerade in desodorierend oder antitranspirierend wirkenden Formulierungen bedeutenden Parfümbestandteilen.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung war, kosmetische Desodorantien zur Verfügung zu stellen, welche über einen längeren Zeitraum, und zwar in der Größenordnung von mindestens einem halben Tag, wirksam sind, ohne daß ihre Wirkung spürbar nachläßt.

Schließlich war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, desodorierende kosmetische Prinzipien zu entwickeln, die möglichst universell in die verschiedensten Darreichungsformen kosmetischer Desodorantien eingearbeitet werden können, ohne auf eine oder wenige spezielle Darreichungsformen festgelegt zu sein.

Pilze, auch Fungi [fungus = lat. Pilz], Mycota [μύκηζ = grch. Pilz] oder Mycobionten genannt, zählen im Gegensatz zu den Bakterien zu den Eucaryonten. Eucaryonten sind Lebewesen, deren Zellen (Eucyten) im Gegensatz zu denen der sogenannten Procaryonten (Procyten) über einen durch Kernhülle und Kernmembran vom restlichen Cytoplasma abgegrenzten Zellkern verfügen. Der Zellkern enthält die Erbinformation in Chromosomen gespeichert.

Zu Vertretern der Mycobionten zählen beispielsweise Hefen (Protoascomycetes), Schimmelpilze (Plectomycetes), Mehltau (Pyrenomycetes), der falsche Mehltau (Phycomycetes) und die Ständerpilze (Basidiomycetes).

Pilze, auch nicht die Basidiomyceten, sind keine pflanzlichen Organismen, haben aber wie diese eine Zellwand, zellsaftgefüllte Vakuolen und eine mikroskopisch gut sichtbare Plasmaströmung. Sie enthalten keine photosynthetischen Pigmente und sind C-heterotroph. Sie wachsen unter aeroben Bedingungen und gewinnen Energie durch Oxidation organischer Substanzen. Einige Vertreter, beispielsweise Hefen, sind allerdings fakultative Anaerobier und zur Energiegewinnung durch Gärungsprozesse befähigt.

Dermatomycosen sind Krankheiten, bei der gewisse Pilzarten, insbesondere Dermatophyten, in die Haut und Haarfollikel eindringen. Die Symptome von Dermatomycosen sind beispielsweise Bläschen, Exfoliation, Rhagaden und Erosion, meist verbunden mit Juckreiz oder allergischem Ekzem.

Dermatomycosen können im wesentlichen in folgende vier Gruppen unterteilt werden: Dermatophytien (z.B. Epidermophytie, Favus, Mikrosporie, Trichophytie), Hefemycosen (z.B. Pityriasis und andere Pityrosporum-bedingte Mycosen, Candida-Infektionen, Blastomycose, Busse-Buschke-Krankheit, Torulose, Piedra alba, Tomlopsidose, Trichosporose), Schimmelmycosen (z.B. Aspergillose, Cephalosporidose, Phycomycose und Skopulariopsidose), Systemmycosen (z.B. Chromomycose, Coccidiomycose, Histoplasmose).

Zu den pathogenen und fakultativ pathogenen Keimen gehören beispielsweise aus der Gruppe der Hefen Candida-Arten (z.B. Candida albicans) und solche der Familie Pityrosporum. Pityrosporum-Arten, insbesondere Pityrosporum ovale, sind für Hauterkrankungen wie Pityriasis versicolor, Seborrhoe in den Formen Seborrhoea oleosa und Seborrhoea sicca, welche sich vor allem als Seborrhoea capitis (= Kopfschuppen) äußern, seborrhoisches Ekzem und Pityrosporum-Follikulitis verantwortlich zu machen. Eine Beteiligung von Pityrosporum ovale an der Entstehung von Psoriasis wird von der Fachwelt diskutiert.

Alle Bereiche der menschlichen Haut können von Dermatomycosen befallen werden. Dermatophytien befallen fast ausschließlich Haut, Haare und Nägel. Hefemycosen können auch Schleimhäute und innere Organe befallen, Systemmycosen erstrecken sich regelmäßig auf ganze Organsysteme.

Besonders häufig sind die Körperbereiche betroffen, auf welchen sich durch Kleidung, Schmuck oder Schuhwerk Feuchtigkeit und Wärme stauen können. So gehört der Fußpilz zu den bekanntesten und am weitesten verbreiteten Dermatomycosen. Besonders unangenehm sind weiterhin Pilzkrankheiten der Finger- und Fußnägelbereiche (Onychomycosen).

Ferner sind Superinfektionen der Haut durch Pilze und Bakterien nicht selten.

Bei bestehendem Primärinfekt, d.h., der normalen Keimbeseiedelung der Haut, eintretende Neuinfektion mit hohen Keimzahlen eines oder mehrerer oft physiologischer Erreger, beispielsweise Staphylokokken, oft aber auch unphysiologischer Erreger, beispielsweise *Candida albicans*, kann bei Zusammentreffen ungünstiger Einflüsse eine "Superinfektion" der befallenen Haut auftreten. Die normale Mikroflora der Haut (oder eines anderen Körperorgans) wird dabei von dem Sekundärerreger regelrecht überwuchert.

Solche Superinfektionen können sich, in Abhängigkeit vom betreffenden Keim, in günstig verlaufenden Fällen in unangenehmen Hauterscheinungen (Juckreiz, unschönes äußeres Erscheinungsbild) äußern. In ungünstig verlaufenden Fällen können sie aber zu großflächiger Zerstörung der Haut führen, im schlimmsten Falle sogar im Tode des Patienten gipfeln.

Superinfektionen der vorab geschilderten Art sind z.B. beim Vollbild von AIDS häufig auftretende Sekundärerkrankungen. An sich - jedenfalls in geringen Keimdichten - unschädliche, aber unter Umständen auch ausgesprochen pathogene Keime überwuchern auf diese Weise die gesunde Hautflora. Bei AIDS allerdings sind auch andere Körperorgane von Superinfektionen betroffen.

Ebenso werden derartige Superinfektionen bei einer Vielzahl dermatologischer Erkrankungen, z.B. atopischem Ekzem, Neurodermitis, Akne, seborrhoischer Dermatitis oder Psoriasis beobachtet. Auch viele medizinische und therapeutische Maßnahmen, z.B. die Radio- oder Chemotherapie von Tumorerkrankungen, als Nebenwirkung hervorgerufene, medikamentös induzierte Immunsuppression oder aber systemische Antibiotikabehandlung, ebenso wie externe chemische oder physikalische Einflüsse (z.B. Umweltverschmutzung, Smog, extreme UV-Lichtexposition), fördern das Auftreten von Superinfektionen der äußeren und inneren Organe, insbesondere der Haut und der Schleimhäute.

Zwar ist es im Einzelfalle ohne weiteres möglich, Superinfektionen mit Antibiotika zu bekämpfen, meistens haben solche Substanzen aber den Nachteil unangenehmer Nebenwirkungen. Oft sind Patienten beispielsweise gegen Penicilline allergisch, weswegen eine entsprechende Behandlung sich in einem solchen Falle verbieten würde.

Ferner haben topisch verabreichte Antibiotika den Nachteil, daß sie die Hautflora nicht nur vom Sekundärerreger befreien, sondern auch die an sich physiologische Hautflora stark beeinträchtigen und der natürliche Heilungsprozeß auf diese Weise wieder gebremst wird.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war, die Nachteile des Standes der Technik zu beseitigen und Substanzen und Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend, zur Verfügung zu stellen, durch deren Verwendung Superinfektionen geheilt werden können, wobei die physiologische Hautflora keine nennenswerte Einbußen erleidet.

Im Gegensatz zu den prokaryotischen und eukaryotischen zellulären Organismen sind Viren [virus = lat. Gift] biologische Strukturen, welche zur Biosynthese eine Wirtszelle benötigen. Extrazelluläre Viren (auch "Virionen" genannt) bestehen aus einer ein- oder doppelsträngigen Nukleinsäuresequenz (DNS oder RNS) und einem Proteinmantel (Capsid genannt), gegebenenfalls einer zusätzlichen lipidhaltigen Hülle (Envelope) umgeben. Die Gesamtheit aus Nukleinsäure und Capsid wird auch Nucleocapsid genannt. Die Klassifikation der Viren erfolgte klassisch nach klinischen Kriterien, heutzutage allerdings zumeist nach ihrer Struktur, ihrer Morphologie, insbesondere aber nach der Nukleinsäuresequenz.

Medizinisch wichtige Virengattungen sind beispielsweise Influenzaviren (Familie der Orthomyxoviridae), Lyssaviren (z.B. Tollwut, Familie der Rhabdoviren) Enteroviren (z.B. Hepatitis-A, Familie der Picornaviridae), Hepadnaviren (z.B. Hepatitis-B, Familie der Hepadnaviridae).

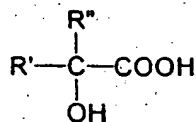
Viruzide, also Viren abtötende Substanzen im eigentlichen Sinne gibt es nicht, da Viren nicht über eigenen Stoffwechsel verfügen. Es wurde aus diesem Grunde auch diskutiert, ob Viren als Lebewesen eingeordnet werden sollten. Pharmakologische Eingriffe ohne Schädigung der nicht befallenen Zellen ist jedenfalls schwierig. Mögliche Wirkmechanismen im Kampfe gegen die Viren sind in erster Linie die Störung deren Replikation, z.B. durch Blockieren der für die Replikation wichtigen Enzyme, die in der Wirtszelle vorliegen. Ferner kann das Freisetzen der viralen Nukleinsäuren in die Wirtszelle verhindert werden. Im Rahmen der hiermit vorgelegten Offenbarung wird unter Begriffen wie "antiviral" oder "gegen Viren wirksam", "viruzid" oder ähnlichen die Eigenschaft einer Substanz verstanden, einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, zu schützen, ungeachtet dessen, was der tatsächliche Wirkmechanismus der Substanz im Einzelfalle sei.

Dem Stande der Technik mangelt es jedoch an gegen Viren wirksamen Substanzen, welche zudem den Wirtsorganismus nicht oder nicht in vertretbarem Maße schädigen.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, diesem Übelstande abzuwehren, also Substanzen zu finden, welche wirksam einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, zu schützen.

Es wurde überraschend gefunden, und darin liegt die Lösung dieser Aufgabe, daß Wirkstoffkombinationen aus

a) einer wirksamen Menge an einer oder mehreren  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren der allgemeinen Formel



wobei jeweils R' und R'' unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe

- (a1) H-,
- (a2) verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-,
- (a3) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Aldehydgruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) substituiertes verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-,
- (a4) Phenyl-,
- (a5) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituiertes Phenyl-, oder wobei das  $\alpha$ -Kohlenstoffatom der  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure mit R' und R'' zusammen eine
- (a6) unsubstituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen oder eine
- (a7) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen ausbildet und wobei die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure oder die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren gegebenenfalls in Form ihrer physiologisch verträglichen Salze und/oder Ethylester und/oder Methylester vorliegen können

und

#### b) Squalen

den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

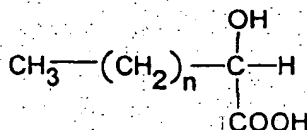
Erfindungsgemäß ist auch die Verwendung solcher Wirkstoffkombinationen als antibakterielle, antimycotische oder antivirale Wirkstoffe. Ganz besonders vorteilhaft ist die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen als gegen grampositive Bakterien wirksame Wirkstoffe.

Die erfindungsgemäßen  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren werden vorteilhaft gewählt aus folgenden Substanzklassen:

- (a2)  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, wobei diese wiederum besonders vorteilhaft aus der Gruppe der C<sub>10-18</sub>-Alkylcarbonsäuren gewählt werden,
- (a3)  $\alpha$ -Hydroxyzuckersäuren, aliphatische  $\alpha$ -Hydroxyfruchtsäuren,
- (a4) unsubstituierte aromatische  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren (z.B. Mandelsäure) bzw.
- (a5) substituierte aromatische  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren.

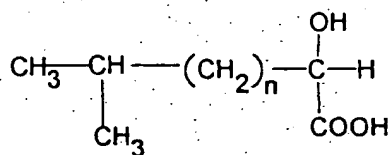
Die unter Punkt (a2) fallenden  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren werden besonders vorteilhaft gewählt aus der Gruppe

-  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren, gemäß der Formel

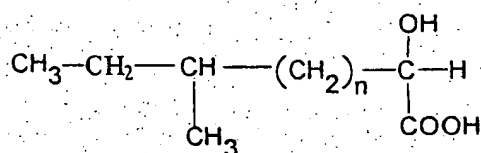


und/oder

-  $\alpha$ -Hydroxy-isocarbonsäuren, gemäß der Formel



und/oder

-  $\alpha$ -Hydroxy-anteisocarbonsäuren, gemäß der Formel

wobei n jeweils eine Zahl von 7 bis 31 darstellt.

Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist,  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren zu verwenden, welche  $\text{C}_{16}$ -Körper darstellen, die also am  $\alpha$ -Kohlenstoffatom eine verzweigte oder unverzweigte  $\text{C}_{14}\text{H}_{29}$ -Kette tragen.

Vorteilhaft ist weiter, Gemische solcher aliphatischen  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren, insbesondere in Form von Wollwachssäuregemischen zu verwenden, in welchen der Gehalt an  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren 20 - 30 Gew.-%, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung beträgt.

Erfindungsgemäß besonders vorteilhaft ist eine Wollwachssäurefraktion, erhältlich durch Rohwollwachssäure durch Kurzwegdestillation im bei  $10^{-1}$  bar aus dem Destillationstemperaturintervall von 150 - 200° C. Der Anteil an  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren beträgt dabei ca. 22 - 27 %. Solche Fraktionen zeichnen sich durch folgende kennzeichnende Parameter aus:

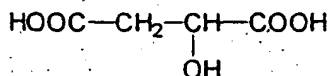
Tropfpunkt	50 - 54° C
Säurezahl	166 - 170
Verseifungszahl	175 - 190
OH-Zahl	60 - 80
Jodzahl	7 - 12.

Die unter Punkt (a3) fallenden  $\alpha$ -Hydroxyzuckersäuren werden besonders vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der

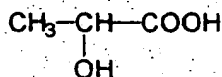
- Aldonsäuren, z.B. Gluconsäure, Galactonsäure
- Aldarsäuren, z.B. Glucarsäure, Galactarsäure (aber auch die Fruchtsäure Weinsäure, die ebenfalls unter die Definition der Aldarsäure fällt)
- Uronsäuren, z.B. Glucuronsäure, Galacturonsäure
- Glycerinsäure

Die unter Punkt (a3) fallenden aliphatischen  $\alpha$ -Hydroxyfruchtsäuren werden besonders vorteilhaft gewählt aus der Gruppe Äpfelsäure, Milchsäure, Citronensäure, Weinsäure.

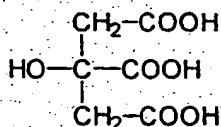
Äpfelsäure (Hydroxybernsteinsäure) ist durch folgende chemische Struktur gekennzeichnet:



Milchsäure (2-Hydroxypropansäure) ist durch folgende chemische Struktur gekennzeichnet:

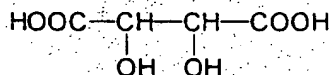


Citronensäure (2-Hydroxy-1,2,3-propantricarbonsäure) ist durch folgende chemische Struktur gekennzeichnet:

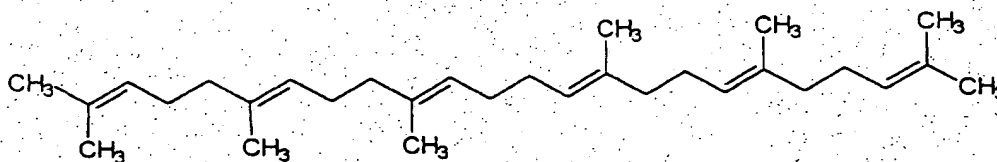


Bekanntermaßen wird Citronensäure zur Pufferung kosmetischer und/oder dermatologischer Zubereitungen, aber auch als Synergist für Antioxidantien in der Haut- und Haarkosmetik verwendet.

Weinsäure (Dihydroxybernsteinsäure) ist durch folgende chemische Struktur gekennzeichnet:



Squalen (2,6,10,15,19,23-Hexamethyl-2,6,10,14,18,22-tetracos-hexaen, auch Spinacen) ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Es hat sich in erstaunlicher Weise herausgestellt, daß die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen das Wachstum von grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten sowie Viren verhindern. Dabei wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen in synergistischer Weise, also überadditiv in bezug auf die Einzelkomponenten.

Insbesondere sind die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen befähigt, daß Wachstum von Hefen, insbesondere der Pityrosporum-Arten, namentlich Pityrosporum ovale, zu verhindern.

Es hat sich ferner herausgestellt, daß die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen die Bildung von seborrhoeischen Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, verhindern sowie bereits vorhandene seborrhoeische Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, zu beseitigen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen eignen sich darüberhinaus gut für die Verwendung als desodorierender Wirkstoff in kosmetischen Desodorantien sowie gegen unreine Haut, leichte Formen der Akne bzw. Propionibakterium acnes.



Schließlich hat sich herausgestellt, daß die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen den Verderb organischer Substanz, insbesondere kosmetischer und dermatologischer Zubereitungen, durch den Befall mit grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten und Viren verhindern können, wenn sie diesen Zubereitungen zugesetzt werden.

5 Erfindungsgemäß sind somit auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen oder dermatologischen Träger, mit dem durch Mycobionten kontaminierten Bereich in Kontakt gebracht werden, sowie ein Verfahren zum Schutze organischer Produkte vor dem Befall mit Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß diesen organischen Produkten die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen in wirksamer Menge zugegeben werden.

10 Der Stand der Technik lieferte folglich nicht den geringsten Hinweis auf die erfindungsgemäße Verwendung als antimycotisches Wirkprinzip.

Ferner war erstaunlich, daß die die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen besonders gut wirksam sind gegen den für das Entstehen von Kopfschuppen verantwortlichen Keim *Pityrosporum ovale* und verwandte Keime. Eine bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung sind mithin gegen Kopfschuppen anzuwendende Formulie-  
15 rungen, beispielsweise Antischuppenshampoos.

Erfindungsgemäß werden die Wirkstoffkombinationen bevorzugt in kosmetischen oder dermatologischen Zusammensetzungen eingesetzt einem Gehalt von 0,005 - 50,0 Gew.-%, insbesondere 0,01 - 20,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung bevorzugt sind. Vorteilhaft enthalten die Zusammensetzungen 0,02 - 10,0 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,02 - 5,0 Gew.-% an den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen, ganz besonders  
20 vorteilhaft 0,5 - 3,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

Es ist auch von Vorteil, anstatt reiner erfindungsgemäßer Einzelkomponenten solche Stoffe zu verwenden, welche sich ihrerseits durch einen Gehalt an erfindungsgemäßen Wirkstoffkomponenten auszeichnen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen lassen sich ohne Schwierigkeiten in gängige kosmetische oder dermatologische Formulierungen einarbeiten, vorteilhaft in Pumpsprays, Aerosolsprays, Crèmes, Salben, Tinkturen,  
25 Lotionen, Nagelpflegeprodukte (z.B. Nagellacke, Nagellackentferner, Nagelbalsame) und dergleichen.

Ganz besonders vorteilhaft liegen die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen in Form von Antischuppen-Shampoos vor.

Es ist auch möglich und gegebenenfalls vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen mit anderen Wirkstoffen zu kombinieren, beispielsweise mit anderen antimikrobiell, antimycotisch bzw. antiviral wirksamen Stoffen.

30 Es ist vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen abzapuffern. Vorteilhaft ist ein pH-Bereich von 3,5 - 7,5. Besonders günstig ist es, den pH-Wert in einem Bereich von 4,0 - 6,5 zu wählen.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung der Haut und/oder der Haare im Sinne einer dermatologischen Behandlung oder einer Behandlung im Sinne der pflegenden Kosmetik dienen. Sie können aber auch in Schminkprodukten in der deko-  
35 rativen Kosmetik eingesetzt werden.

Zur Anwendung werden die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen in der für Kosmetika und Dermatika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Vorteilhaft sind solche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmit-  
40 tels vorliegen. Vorteilhaft enthalten diese zusätzlich mindestens einen UVA-Filter und/oder mindestens einen UVB-Filter und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Kosmetische Zubereitungen gemäß der Erfindung zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen können in verschiedenen Formen vorliegen, wie sie z.B. üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen eingesetzt werden. So können sie z.B. eine Lösung, eine Emulsion bzw. Mikroemulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), oder eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W), ein Gel, eine Hydrodispersion, einen festen Stift oder auch ein Aerosol darstellen.  
45

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Antioxidantien, Parfüme, Mittel zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende Substanzen, anfeuchtende und/oder feuchthaltende  
50 Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung eine Lösung oder Lotion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- 55
- Wasser oder wäßrige Lösungen;
  - Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
  - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;

- Alkohole, Diöle oder Polyöle niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

5 Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B.  $\mu\text{mol/kg}$ ), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z.B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg - Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin E - acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A - palmitat) sowie Konyferylbenzoat des Benzoeharzes, Rütinsäure und deren Derivate, Femlasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretssäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B.  $\text{ZnO}$ ,  $\text{ZnSO}_4$ ) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

50 Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

35 Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z.B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

40 Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propanediol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wässrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

45 Feste Stifte gemäß der Erfindung enthalten z.B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fettsäureester. Bevorzugt werden Lippenpflegestifte sowie desodorierende Stifte ("Deo-Sticks").

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische oder dermatologische Zubereitungen sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, z.B. Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

50 Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Bevorzugt können die erfindungsgemäßen Zubereitungen zudem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel dienen.

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- 5 - Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 10 - 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze;
- 15 - Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

20 Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Bei kosmetischen Zubereitungen zur Pflege der Haare handelt es sich beispielsweise um Shampooierungsmittel, 35 Zubereitungen, die beim Spülen der Haare vor oder nach der Shampooierung, vor oder nach der Dauerwellbehandlung, vor oder nach der Färbung oder Entfärbung der Haare angewendet werden, um Zubereitungen zum Föhnen oder Einlegen der Haare, Zubereitungen zum Färben oder Entfärben, um eine Frisier- und Behandlungslotion, einen Haarlack oder um Dauerwellmittel.

Die kosmetischen Zubereitungen enthalten Wirkstoffe und Hilfsstoffe, wie sie üblicherweise für diesen Typ von 40 Zubereitungen zur Haarpflege und Haarbehandlung verwendet werden.

Als Hilfsstoffe dienen Konservierungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Emulgatoren, Verdickungsmittel, Fette, Öle, Wachse, organische Lösungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Farbstoffe oder Pigmente, deren Aufgabe es ist, die Haare oder die Zubereitung selbst zu färben, Elektrolyte, Zubereitungen gegen das Fetten der Haare.

45 Kosmetische Zubereitungen, die ein Shampooierungsmittel oder eine Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung darstellen, enthalten vorzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, erfindungsgemäße Wirkstoffkombinationen und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden.

Beispiele für oberflächenaktive Substanzen, die erfindungsgemäß vorteilhaft verwendet werden können, sind herkömmliche Seifen, z.B. Fettsäuresalze des Natriums, Alkylsulfate, Alkylethersulfate, Alkan- und Alkylbenzolsulfonate, 50 Sulfoacetate, Sulfobetaine, Sarcosinate, Amidosulfobetaine, Sulfosuccinate, Sulfobornsteinsäurehalbester, Alkylethercarboxylate, Eiweiß-Fettsäure-Kondensate, Alkylbetaine und Amidobetaine, Fettsäurealkanolamide, Polyglycolether-Derivate.

Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 Gew.-% und 50 Gew.-% in dem Shampooierungsmittel, bzw. der Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung, vorliegen.

55 Liegt die kosmetische oder dermatologische Zubereitung in Form einer Lotion vor, die ausgespült und z.B. vor oder nach der Entfärbung, vor oder nach der Shampooierung, zwischen zwei Shampooierungsschritten, vor oder nach der Dauerwellbehandlung angewendet wird, so handelt es sich dabei z.B. um wäßrige oder wäßrig-alkoholische Lösungen, die gegebenenfalls oberflächenaktive Substanzen enthalten, bevorzugt nichtionische oder kationische oberflä-

chenaktive Substanzen, deren Konzentration zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,2 und 5 Gew.-%, liegen kann. Diese kosmetische oder dermatologische Zubereitung kann auch ein Aerosol mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Eine kosmetische Zubereitung in Form einer Lotion, die nicht ausgespült wird, insbesondere eine Lotion zum Einlegen der Haare, eine Lotion, die beim Fönen der Haare verwendet wird, eine Frisier- und Behandlungslotion, stellt im allgemeinen eine wäßrige, alkoholische oder wäßrig-alkoholische Lösung dar und enthält mindestens ein kationisches, anionisches, nicht-ionisches oder amphoter Polymer oder auch Gemische derselben, sowie erfindungsgemäße Wirkstoffkombinationen. Die Menge der verwendeten erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen liegt z.B. zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,1 und 3 Gew.-%.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare, die die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ionische Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen. Anionische Emulsionen sind vorzugsweise vom Typ einer Seife und enthalten mindestens eine erfindungsgemäße ethoxylierte oder propoxylierte organische Verbindung mit anionischem oder nicht-ionischem Charakter.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare können als Gele vorliegen, die neben erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln noch organische Verdickungsmittel, z.B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z.B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist im Gel z.B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Vorzugsweise beträgt die Menge der erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen in einem für die Haare bestimmten Mittel 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,5 Gew.-% bis 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die folgenden Beispiele sollen die Verkörperungen der vorliegenden Erfindungen verdeutlichen. Die Angaben beziehen sich stets auf Gewichts-%, sofern nicht andere Angaben gemacht werden.

Die Bezeichnung „WWS“ bedeutet in den Beispielen eine Wollwachssäurefraktion, erhältlich durch Rohwollwachssäure durch Kurzwegdestillation im bei  $10^{-1}$  bar aus dem Destillationstemperaturintervall von 150 - 200° C. Der Anteil an  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren beträgt dabei ca. 22 - 27 %.

#### Beispiel 1

W/O-Crème		
	I	II
Paraffinöl	10,00	10,00
Ozokerit	4,00	4,00
Vaseline	4,00	4,00
pflanzliches Öl	10,00	10,00
Wollwachsalkohol	2,00	2,00
Aluminiumstearat	0,40	0,40
WWS	0,50	-
Milchsäure	-	0,30
Squalen	1,00	1,00
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 2

5

10

15

20

25

W/O-Lotion		
	I	II
Paraffinöl	25,00	25,00
Siliconöl	2,00	2,00
Ceresin	1,50	1,50
Wollwachsalkohol	0,50	0,50
Glucosesesquiosstearat	2,50	2,50
Gluconsäure	0,50	-
Weinsäure	-	0,50
Squalen	0,70	0,70
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5- 6,0 .....	

30 Beispiel 3

35

40

45

50

55

O/W-Lotion		
	I	II
Paraffinöl	5,00	5,00
Isopropylpalmitat	5,00	5,00
Cetylalkohol	2,00	2,00
Bienenwachs	2,00	2,00
Ceteareth-20	2,00	2,00
PEG-20-Glycerylstearat	1,50	1,50
Glycerin	3,00	3,00
Äpfelsäure	0,30	-
Citronensäure	-	0,30
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 4

5

10

15

20

25

30

Beispiel 5

35

40

45

50

55

O/W-Crème		
	I	II
Pflanzliches Öl	10,00	10,00
Cetylalkohol	2,00	2,00
Glycerinmonostearat	1,50	1,50
PEG-30-Glycerylstearat	2,00	2,00
Glycerin	3,00	3,00
Isopropylpalmitat	5,00	5,00
Carbopol 980 (neutralisiert)	0,30	0,30
WWS	1,00	-
Mandelsäure	-	0,30
Squalen	0,20	0,20
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Salbe		
	I	II
Vaseline	36,00	36,00
Ceresin	10,00	10,00
Zinkoxid	4,00	4,00
Pflanzliches Öl	20,00	20,00
WWS	0,50	-
Galactarsäure	-	0,80
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Paraffinöl	..... ad 100,00 .....	

Beispiel 6

5

10

15

20

Hautöl		
	I	II
Cetylpalmitat	3,00	3,00
C <sub>12-15</sub> - Alkylbenzoat	2,00	2,00
Polyisobuten	10,00	10,00
Squalan	2,00	2,00
Glycerinsäure	0,10	-
Milchsäure	-	0,10
Squalen	0,80	0,80
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Paraffinöl	..... ad 100,00 .....	

25 Beispiel 7

30

35

40

45

50

55

Badeöl		
	I	II
Paraffinöl	20,00	20,00
PEG-40-hydriertes Rizinusöl	5,00	5,00
Glucuronsäure	0,40	-
Galactarsäure	-	0,40
Squalen	1,00	1,00
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Sojaöl	..... ad 100,00 .....	

Beispiel 8

5

10

15

20

25

Lippenstift		
	I	II
Ceresin	8,00	8,00
Bienenwachs	4,00	4,00
Carnaubawachs	2,00	2,00
Vaseline	40,00	40,00
Hydriertes Rizinusöl	4,00	4,00
Caprylic/Capric Triglyceride	6,00	6,00
WWS	0,20	-
Citronensäure	-	0,20
Squalen	0,40	0,40
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Paraffinöl	..... ad 100,00 .....	

Beispiel 9

30

35

40

45

50

55

Pflagemaske		
	I	II
PEG-50 Lanolin	0,50	0,50
Glycerylstearat	2,00	2,00
Sonnenblumenkernöl	3,00	3,00
Bentonit	8,00	8,00
Kaolin	35,00	35,00
Zinkoxid	5,00	5,00
Äpfelsäure	0,80	-
Citronensäure	-	0,80
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	



Beispiel 10

5

10

15

20

25

Liposomenhaltiges Gel		
	I	II
Lecithin	6,00	6,00
Pflanzliches Öl	12,50	12,50
Hydrolysiertes Kollagen	2,00	2,00
Xanthan Gum	1,40	1,40
Butylenglycol	3,00	3,00
$\alpha$ -Hydroxydecansäure	0,20	-
$\alpha$ -Hydroxyhexadecansäure	-	0,20
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 11

30

35

40

45

50

Duschpräparat mit Rückfetter		
	I	II
Cocoamidodiacetat	10,00	10,00
Natriumlaurylsulfat	25,00	25,00
Kalium Cocyl Hydrolysiertes Kollagen	5,00	5,00
Macadamianußöl	5,00	5,00
Natriumchlorid	0,60	0,60
Mandelsäure	0,20	-
Weinsäure	-	0,20
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

55

Beispiel 12

5

10

15

20

Seifenstück		
	I	II
Na-Salz aus Talgfettsäuren	60,00	60,00
Na-Salz aus Kokosöl	28,00	28,00
Natriumchlorid	0,50	0,50
Weinsäure	0,50	-
Äpfelsäure	-	0,50
Squalen	1,00	1,00
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	

Beispiel 13

25

30

35

40

45

50

Syndetseife		
	I	II
Natriumlaurylsulfat	30,00	30,00
Natriumsulfosuccinat	10,00	10,00
Kaliumcocoyl hydrolysiertes Kollagen	2,00	2,00
Dimethicon Copolyol	2,00	2,00
Paraffin	2,00	2,00
Maisstärke	10,00	10,00
Talcum	10,00	10,00
Glycerin	3,00	3,00
WWS	0,50	-
Milchsäure	-	0,30
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 -6,0 .....	

55

Beispiel 14

5

10

15

20

25

Beispiel 15

30

35

40

45

50

55

Haarpflegemittel		
	I	II
TEA-Cocoyl hydrolysiertes Kollagen	30,00	30,00
Monoethanolaminlaurylsulfat	25,00	25,00
Mandelöl	2,00	2,00
Natriumchlorid	1,00	1,00
WWS	0,30	-
Mandelsäure	-	0,30
Squalen	0,20	0,20
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 -6,0 .....	

Pflegeshampoo		
	I	II
Natriumlaurylsulfat	34,00	34,00
Dinatriumlaurylsulfosuccinat	6,00	6,00
Cocoamidopropylbetain	10,00	10,00
Glycoldistearat	5,00	5,00
Citronensäure	0,20	-
Weinsäure	-	0,20
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 16

5

10

15

20

25

Beispiel 17

30

35

40

45

50

55

Haarkur		
	I	II
Cetylalkohol	5,00	5,00
Caprylic/Capric Triglyceride	3,00	3,00
Petrolatum	2,00	2,00
Wollwachsalkohol	0,50	0,50
WWS	0,50	-
Milchsäure	-	0,30
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Haarspülung		
	I	II
Cocoamidopropylbetain	5,00	5,00
Cetylalkohol	2,00	2,00
Propylenglycol	2,00	2,00
Citronensäure	0,30	-
Milchsäure	-	0,30
Squalen	0,80	0,80
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 18

5

10

15

20

Haarfestiger		
	I	II
Polyvinylpyrrolidon/Vinylacetat/Vinylpropionat-Copolymer	5,00	5,00
Ethanol	45,00	45,00
WWS	0,10	-
Milchsäure	-	0,10
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 19

25

30

35

40

45

50

55

Frisiercrème		
	I	II
Vaseline	4,00	4,00
Cetearylalkohol	4,00	4,00
PEG-40-hydriertes Rizinusöl	2,00	2,00
Isopropylpalmitat	5,00	5,00
Citronensäure	1,00	-
Äpfelsäure	-	1,00
Squalen	0,30	0,30
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 20

5

10

15

20

25

Rasierschaum		
	I	II
Stearinsäure	7,00	7,00
Natriumlaurylsulfat	3,00	3,00
Stearylalkohol	1,00	3,00
Glycerin	5,00	5,00
Triethanolamin	3,60	3,60
Weinsäure	0,10	-
Milchsäure	-	0,10
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 21

30

35

40

45

50

55

Fußcrème		
	I	II
Soluan 5	2,00	2,00
Methylsalicylat	5,00	5,00
Caprylic/Capric Triglyceride	10,00	10,00
Stearinsäure	5,00	5,00
Cetylalkohol	1,00	1,00
Glycerin	2,00	2,00
Dimethicon	1,00	1,00
Carbopol 984	0,50	0,50
Triethanolamin	1,50	1,50
Gluconsäure	0,50	-
Galactonsäure	-	0,50
Squalen	0,70	0,70
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 22

5

10

15

Aerosolspray		
	I	II
Octyldodecanol	0,50	0,50
WWS	0,30	-
Milchsäure	-	0,10
Squalen	0,20	0,20
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Ethanol	..... ad 100,00 .....	

20

Die durch Zusammenmischung der jeweiligen Bestandteile erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan-Butan-Gemisch (2:7) im Verhältnis 39:61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

Beispiel 23

25

30

35

40

45

50

55

Pumpspray		
	I	II
PEG-40-Hydriertes Rizinusöl	2,00	2,00
Glycerin	1,00	1,00
Glycerinsäure	0,30	-
Citronensäure	-	0,30
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 24

Roll-on-Gel		
	I	II
1,3-Butylenglycol	2,00	2,00
PEG-40-Hydriertes Rizinusöl	2,00	2,00
Hydroxyethylcellulose	0,50	0,50
Glucarsäure	0,50	-
Milchsäure	-	0,20
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	

Beispiel 25

Roll-on-Emulsion		
	I	II
Tricetarethphosphat	0,30	0,30
Octyldodecanol	2,00	2,00
C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoat	2,00	2,00
C <sub>10-30</sub> -Alkylacrylat	0,15	0,15
WWS	0,30	-
$\alpha$ -Hydroxydodecansäure	-	0,40
Squalen	0,70	0,70
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Wasser, VES	..... ad 100,00 .....	
pH:	..... ad 5,5 - 6,0 .....	



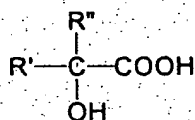
## Beispiel 26

Wachsstift		
	I	II
Hydriertes Rizinusöl	5,00	5,00
Bienenwachs	6,00	6,00
Ceresin	30,00	30,00
C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoat	17,00	17,00
WWS	0,40	-
Milchsäure	-	0,20
Squalen	0,50	0,50
Parfum, Konservierungsstoffe	..... q.s. ....	
Octyldodecanol	..... ad 100,00 .....	

## Patentansprüche

## 1. Wirkstoffkombinationen aus

a) einer wirksamen Menge an einer oder mehreren  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren der allgemeinen Formel



wobei jeweils R' und R'' unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe

(a1) H-,

(a2) verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-,

(a3) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Aldehydgruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) substituiertes verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-

(a4) Phenyl-,

(a5) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituiertes Phenyl-, oder wobei das  $\alpha$ -Kohlenstoffatom der  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure mit R' und R'' zusammen eine

(a6) unsubstituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen oder eine

(a7) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen ausbildet und

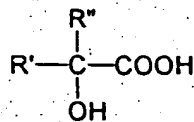
wobei die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure oder die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren gegebenenfalls in Form ihrer physiologisch verträglichen Salze und/oder Ethylester und/oder Methylester vorliegen können

und

b) Squalen.

## 2. Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus

a) einer wirksamen Menge an einer oder mehreren  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren der allgemeinen Formel



wobei jeweils R' und R'' unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe

(a1) H-,

(a2) verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-,

(a3) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Aldehydgruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) substituiertes verzweigtes oder unverzweigtes C<sub>1-27</sub>-Alkyl-

(a4) Phenyl-,

(a5) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituiertes Phenyl-, oder wobei das  $\alpha$ -Kohlenstoffatom der  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure mit R' und R'' zusammen eine

(a6) unsubstituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen oder eine

(a7) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C<sub>1-27</sub>-Alkylgruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen ausbildet und

wobei die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäure oder die  $\alpha$ -Hydroxycarbonsäuren gegebenenfalls in Form ihrer physiologisch verträglichen Salze und/oder Ethylester und/oder Methylester vorliegen können

und

b) Squalen

als antibakterielle, antimycotische oder antivirale Wirkstoffe.



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

der nach Regel 45 des Europäischen Patent-  
übereinkommens für das weitere Verfahren als  
europäischer Recherchenbericht gilt

EP 96 11 7993

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6)
P,X	DATABASE WPI. Week 9650 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 96-502608 XP002022238 & JP-A-08 259 420 (LION CORP.) , 8. Oktober 1996 * Zusammenfassung * ---	1,2	A61K31/01 A61K45/06 C11B11/00
X	US-A-4 234 599 (VAN SCOTT EUGENE J ET AL) 18. November 1980	1,2	
Y	* Spalte 2, Zeile 39-44; Ansprüche 1,13; Beispiele 8,9,12 * * Spalte 2, Zeile 53 - Spalte 3, Zeile 2 * ---	2	
X	CA-A-1 253 807 (J. VALENTINE AND M. COTÉ) * Seite 1, Zeile 26 - Seite 2, Zeile 18 * * Seite 3, Zeile 21 - Seite 4, Zeile 4; Ansprüche 1,2,12,13; Beispiele 1-3 * --- -/--	1,2	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.6)
			A61K C11B
<b>UNVOLLSTÄNDIGE RECHERCHE</b> Nach Auffassung der Recherchenabteilung entspricht die vorliegende europäische Patentanmeldung den Vorschriften des Europäischen Patentübereinkommens so wenig, daß es nicht möglich ist, auf der Grundlage einiger Patentansprüche sinnvolle Ermittlungen über den Stand der Technik durchzuführen. Vollständig recherchierte Patentansprüche: Unvollständig recherchierte Patentansprüche: Nicht recherchierte Patentansprüche: Grund für die Beschränkung der Recherche:  Siehe Ergänzungsblatt C			
Recherchemort DEN HAAG		Abschlußdatum der Recherche 7. Januar 1997	Prüfer Kanbier, D
<b>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN</b> X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	

EPO FORM 150 (01.91) (P4029)



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung  
EP 96 11 7993

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6)
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 639 (C-1282), 6.Dezember 1994 & JP-A-06 247852 (SEKISUI CHEM CO LTD), 6.September 1994, * Zusammenfassung * & DATABASE WPI Week 9440 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 94-322092 & JP-A-06 247 852 (SEKISUI CHEM IND CO LTD) , 6.September 1994 * Zusammenfassung *	1,2	
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 95, no. 005 & JP-A-07 138142 (NOEVIR CO LTD), 30.Mai 1995, * Zusammenfassung * & DATABASE WPI Week 9530 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 95-228605 & JP-A-07 138 142 (NOEVIR KK) , 30.Mai 1995 * Zusammenfassung *	1,2	RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.6)
X	--- EP-A-0 467 218 (BEIERSDORF AG) 22.Januar 1992 * Seite 3, Zeile 11 - Seite 4, Zeile 49 * * Seite 5, Zeile 3-38; Ansprüche 1,3-5,10; Beispiele 1-4,9,10 * --- -/-	1	

EPO FORM 150 (12/92) (P0412)

## EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT

PO FORM 1503 02.82 (P04C12)

28



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

EP 96 11 7993

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6)
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	
X	US-A-5 411 734 (VARGAS ANTHONY ET AL) 2.Mai 1995 * Spalte 1, Zeile 61-63; Anspruch 1; Beispiel 2; Tabelle 2 * * Spalte 2, Zeile 26-27 * * Spalte 3, Zeile 39 - Spalte 4, Zeile 27 * ---	1	
X	US-A-5 393 526 (CASTRO JOHN R) 28.Februar 1995 * Spalte 2; Ansprüche 1,6; Beispiel 2; Tabelle 2 * ---	1	
Y	DATABASE WPI Week 8613 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 86-084405 XP002022242 & JP-A-61 030 508 (NIPPON OILS & FATS KK) ; 12.Februar 1986 * Zusammenfassung * ---	2	RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.6)
Y	US-A-4 849 211 (SCHRAUZER GERHARD N) 18.Juli 1989 * Spalte 2, Zeile 29-31; Anspruch 1 * * Spalte 2, Zeile 50-57 * -----	2	

EPO FORM 150 (11/81) (P/C12)



Europäisches Patentamt

EP 96 11 7993 - C -

**UNVOLLSTÄNDIGE RECHERCHE**

Nach Auffassung der Recherchenabteilung entspricht die vorliegende europäische Patentanmeldung den Vorschriften des Europäischen patentübereinkommens so wenig, daß es nicht möglich ist, auf der Grundlage einiger Patentansprüche sinnvolle Ermittlungen über den Stand der Technik durchzuführen.

Vollständig recherchierte Patentansprüche:

Unvollständig recherchierte Patentansprüche: 1,2

Nicht recherchierte Patentansprüche:

Grund für die Beschränkung der Recherche: Wegen der grossen Zahl der Verbindungen, die die Formel in Ansprüche 1,2 theoretisch definiert, musste die Recherche aus ökonomischen Gründen eingeschränkt werden.

Die Recherche beschränkte sich auf die Verbindungen mit pharmakologischen Daten und auf die in den Beispiele/Beschreibung spezifizierten Substanzen (Richtlinien, Teil B, Kapitel III, Paragraph 3.6).

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER: \_\_\_\_\_**

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**